THIAZOLIDING DERIVATIVE

Patent number:

JP55022636

Publication date:

1980-02-18

Inventor:

KAWAMATSU YUTAKA; others: 01

Applicant:

TAKEDA CHEM IND LTD

Classification:

- international:

C07D277/34; C07D413/12

- european:

Application number:

JP19780095673 19780804

Priority number(s):

Also published as:

EP0008203 (A1)
US4444779 (A1)

US4438141 (A1) US4340605 (A1)

US4287200 (A1)

more >>

Abstract of JP55022636

NEW MATERIAL:A thiazolidine devivative of formula I: (R1 is alkyl, cycloalkyl, phenylalkyl, phenyl, or five-or six-membered heterocyclic group having one or two hetero atoms selected from N,O, and S; R<2> is direct bond or lower alkylene group; L<1> and L<2> are lower alkyl groups when R<2> is alkyl group; or L<1> and L<2> may form alkylene group, or L<1> and L<2> may form alkylene group, or L<1> and L<2> may be H other than those described above).

EXAMPLE:2,4-Dioxo-5-[4-(2-methyl-2-phenyl

propyloxy) benzyl] thiazolidine.

USE:Remedies for hyperlipemia, diabetes and their complication having hypolipemic and

hypoglycemic actions.

PROCESS:An alpha-halogenocarboxylic acid of formula II: (X is halogen; Z is lower alkoxy group) is reacted with thiourea to give a compound of formula III, which is hydrolyzed to form the compound of formula I.

$$L^{2} - C - R^{2} - 0 \longrightarrow CH_{2} - CH \longrightarrow C = 0$$

$$R^{1}$$

$$R^{1}$$

$$R^{2}$$

$$R^{3}$$

$$R^{4}$$

$$R^{2}$$

$$R^{3}$$

$$R^{4}$$

$$R^{5}$$

$$R^{5}$$

$$R^{5}$$

$$R^{5}$$

$$R^{5}$$

$$\begin{array}{c|c} \Gamma_1 \\ \Gamma_8 - C - B_5 - O \end{array} \longrightarrow \begin{array}{c} CB^8 & CH - COZ \\ I \\ I \\ I \end{array}$$

$$L^{2} \xrightarrow{i} CE - C = 0$$

$$E^{1} \xrightarrow{i} NE$$

Data supplied from the esp@cenet database - Worldwide

(9 日本国特許庁 (JP)

10特許出願公開

⑩公開特許公報(A)

昭55—22636

⊕Int. Cl. ³	識別記号	庁内整理番号	❸公開 昭和55年(1980)2月18日
C 07 D 277/34		7306—4 C	
413/12	·	6365—4 C	発明の数 1
// A 61 K 31/425	ADP	·	審査請求 未請求
31/44	ADP	•	
31/535	ADP		•
(C 07 D 413/12			
277/00	•		
317/00 🤈		•	
(C 07 D 413/12		•	• • •
213/00		7138—4 C	•
277/00)		*	(全 8 頁)

69チアゾリジン誘導体

@特 昭53-95673

❷出 昭53(1978) 8月4日

@発 明

京都市西京区大原野上里鳥見町

15番地の3

武田菜品工業株式会社

大阪市東区道修町2丁目27番地

人 弁理士 松居祥二

最終頁に続く

10

/ 発明の名称

2 特許請求の範囲

一般式

$$\begin{array}{c|c} & & & & \\ & &$$

エニルアルキル基。フエニル基。窒素原子。酸素 原子。イオウ原子から選ばれたヘテロ原子を1個 または2個存する5または6員の具項環塞または $R^{i}>_{H-}$ (ただし R^{i} 。 R^{i} は闰一または異なつて低 級アルキル基を示すかまたは BPと BYが直接もしく は密案原子,酸素原子,イオウ原子から選ばれた ヘテロ原子を介して結合し、R*。R*C隣接する窓 緊原子とともに5 または5 **貝環を形成していても** よい)で表わされる基を示す。 叶は結合手または 低級アルキレン基を示す。 BMアルキル基である

ときひ。エセは同一または異なつて低級アルキル基 を示すかまたは ぴと ぴが結合してアルキレン基を ときはぴ、ぴは上記定義の他に水素原子であつて もよい〕で表わされるチアゾリジン誘導体

本発明は血中脳質、絶低下作用を有する新規チ アソリジン防導体に関する。さらに詳しくは、本

エニルアルキル基。フエニル基。窓業原子。酸素 原子。イオウ原子から選ばれたヘテロ原子を1個 または2個有する5または6員の具項環基または Pⁱ>H- (ただしRⁱ,R*は月一または異なつて低 級アルキル基を示すかせたは BPと BPが直接もしく

ヘテロ原子を介して結合し、RI、RYに隣接する選 環原子とともにままたはの具理を形成していても よい)で表わされる基を示す。RYは結合手または 低級アルキレン基を示す。Rがアルキル基である ときい。LYは同一または異なつて低級アルキル基 を示すかまたはいとLYが結合してアルキレン基を 形成していてもよい。またBがアルキル基でない

ときはぴ。ぴは上記定義の他その一方または双方

が水素原子であつてもよい〕で表わされるチァソ

前記一般式(【)中、Pで示されるアルキル基としてはたとえばメチル。エチル。ロープロピル・
・1ープロピル・ロープチル・1ープチル・セープチル・ローペンチル・1ーペンチル・ローペキ
シル・ローペンチル・ローオクチル・ローノニル
・ローデシルなど値鎖状または分枝状の炭素数1
~100ものが、シクロアルキル基としてはたと
えばシタロプロピル・シクロペンチル・シクロペ
キシル・シタロペアチルなど炭素数5~7のものが、フエニルアルキル基としてはたとえばペンジ

リジン酵毒体に関する。

)で扱わされる。

すなわち Rが結合手のときはその両どなりの原子が直接結合していることを意味する。 Li、Liuで示される低級アルキル基としてはたとえばメチル・エチルなど炭素数 1~3のものがあげられる。 また Li と Liuが結合して形成されるアルキレン基は式ー(CB。)nー 〔式中 n は 2~6の整数である〕で示される基を意味する。前記 Biuで示されるシクロアルキル基。フェニルアルキル基。フェニルエルアルキル基。フェニルアルキル基。フェニルアルキル基。フェニルアルキル基。フェニルアルキル基。フェニルアルキル基。フェニルアルキル基。フェニルアルキル基。フェニルアルキル基。フェニルアルキル基。フェニルアルキル基。フェニルアルキル基。フェニルアルカーで示される長項環基は現の任意の位置に1~5個の置換基を有していてもよく、その個換基としてはたとえばメチル。エチルなどの低級アルコキル基。たとえばメチル。エトキルなどのハロゲン原子。水酸基などがあげられる。またたとえばメチレンジオキル基をど、1~10で

特開 昭55-22636(2)

ル。フエネナルなど炭素数で~11のものがあげ られる。またBで示される美項環塞としてはたと えばピリジール、チエニル、フリール、チアゾリ ールなど図案原子,酸緊原子。イオウ原子から遊 ばれたヘテロ原子を1個または2個有する5また は6貝のものかわげられる。 Bが pi > i - である とき、Bookで示される低級アルキル基としては たとえばメナル,エチル,コープロピル、1-プ ロピル。ロープチルなど炭素数1~4のものが、 また B'と R'が結合し R' >B- で5または6 異の異 項環基を形成しているとき、その具項環基として はたとえばピペリジノ、モルホリノ、ピロリジノ ,ピペラジノなど窓業原子,酸素原子,イオウ原 子から選ばれたヘテロ原子を介して結合したもの があげられる。 Bで示される低級アルキレン益と してはたとえばメチレン。エチレン。トリメチレ ンなど炭素数1~3のものがあげられる。また B! で示される結合手は化学構造式において「一」。 「・」などで示されるものをいい、『が結合手で あるとき一般式(1)の化合物は下記一般式(1

(CB。)n-0- 〔式中 m は 1 ~ 3 の整数である〕 で示されるアルキレンジオキシ基が現上の路接する 2 個の炭素原子と結合して関の環を形成していてもよい。

一般式(1)で表わされる本発明の化合物は常 法により程々の塩を形成させることができる。た とえば単で示される異項環基が三級家室原子を含 むとき、また Bbs PP で表わされる基を示す ときは、たとえば塩酸,硫酸,酢酸,蓚酸などの 酸塩を形成させることができる。また Bがその中 **に三級電素を含まないときはたとえばナトリウム** 塩。カリウム塩。カルシウム塩。アンモニウム塩 などのオチオンとの塩を形成させることができる。 本発明のチアゾリジン誘導体(【)は結尿病白 然発症マウスミEAF の血糖⇒とび血中のトッグ りセライドを低下せしめる作用を有し、人の高階 車症 · 糖尿病⇒よびそれらの合併症の治療に有用 であることが期待される。投与方法は、たとえば 候剤、カプセル剤、散剤、顆粒剤などとして毎日 的に用いられるほか注射剤。皮剤。ペレフトなど

として非経口的に投与することができる。高脂血症治療剤として用いる 合は成人1人につき通常 1日50㎞~18を経口的または非経口的に、また糖尿病治療剤としては成人1人につき通常1日 10%~18を経口非経口的に投与することができる。

本発明のチアゾリジン誘導体(【】) はたとえば つぎのようにして製造することができる。 すなわ ち一般式

$$L^{1}$$

$$L^{0}-C-R^{1}-0$$

$$R^{1}$$

$$R^{1}$$

$$R^{1}$$

$$R^{2}$$

$$R^{3}$$

$$R^{3}$$

$$R^{3}$$

$$R^{3}$$

「式中、B', R', D'かよび L'社前記と同意發であり、スはクロル・プロムなどのハロゲン原子を、
るはメトキシ、エトキシなどの低級アルコキシ基
、水酸基・アミノ基または式→OM(MはNa。

Kなどのアルカリ金属原子・NB・などを示す)で
表わされる基を示す。〕で表わされるα→ハロヴ
ノカルギン酸類とチオ尿素を反応させて一般式



ルボン酸類(目)1モルド対し、1~3モルである。反応温度、反応時間などの反応条件は用いられる原料、溶除などにより異るが通常反応は溶体の沸点もしくは100~130℃で散時間~十数時間行なわれる。とのようにして難溶性のイミノ体(胃)を得るととができる。とのイミノ体(胃)は単離したのちまたは単離するととなくつぎの加水分解工程に付される。

加水分解工程はイミノ体(『])を適当を将継中(たとえばスルホランなど)水かよび鉱酸の存在下加熱するととにより行なわれる。酸の添加量は通常α-ハロゲノカルポン酸類(『)1モルに対しの。1~10モル。好ましくは0。2~3モル、水の添加量はα-ハロゲノカルポン酸(『)1モルに対し通常大過剰量である。加熱時間は通常数時間~十数時間である。

とのようにして得られるテアメリジン誘導体(「)は公知の分離精製手段たとえば連絡・被圧進 船。溶体抽出、晶出、再結晶、転用・クロマトダ ファイーなどにより単離精製することができる。



特朗 昭55--22636 (3)

(式中、 p¹, p², p², p²かよび p²社前配と同意義である)で表わされる 2 ~ イミノチアゾリジン断導体を得、ついでとれを加水分解するととにより一般式(Ⅰ) で表わされるチアゾリジン断導体(Ⅰ)を得るととができる。

α-ハロゲノカルボン酸類(目)とチオ尿素と 10
の反応は通常溶体中で行なわれる。 該溶体として
は、たとえばメタノール・エタノール・プロパノ
ール・プタノール・エチレングリコールモノメチ
ルエーテルなどのアルコール類・テトラモドロフ
ラン・ジオキサンなどのエーテル類の他アセトン
リジメチルスルホキシド・スルホラン・ジメチル
ホルムアミドなどがあげられる原料の接触部合は
特に限定されないが通常αーハロゲノカルボン酸
類(目)に対して当モルよりや、過剰のチオ尿素
を使用するのがよい。 行ましくはα-ハロゲノカ



なか本発明に保る化合物(【)を製造する際に 原料として用いられるαーハロゲノカルボン酸類 (量)はたとえば相当するアニリン類をジアゾ化 し、ついでメイルパイン アリレイション(Mererwein Arylation) を行うことにより製造することができる。

以下に参考例かよび失施例を記載して本発明を より具体的に説明する。

お考例!

4-[3-(3,3-ジアチルアミノ)エチルオキシ]ニトロペンゼン19.0gをメタノール300回にとかし10分下4-C(50分をも)3gを加え遊園、1気圧で接触変元を行う。75分間で約4.45の水薬を吸収する。無路を対別し、超液を減圧下に濃縮し、残留する液状物をメタノール100回ーアセトン100回にとかす。適塩酸21.5回を加え、0℃に冷却し、亜硝酸ナトリウム49gの水10回港液を5℃以下で適加する。5℃で30分かさまぜた装アクリル酸メチル33.3g(34.9回)を加え、反応液を

3 5 ℃ に加熱する。酸化第一銅1 8 €、少量ずつ 加えると、 密素ガスが発生し、反応依は 4 6 ℃ 電 で上升する。 寅温にもどるまで1 時間かきまぜた 後、一夜放置する。 減圧下に再練を留去し、 濃アンモニア水で、強アルカリ性とした後、水を加えて酢酸エチルで抽出する。 水洗 . 乾燥 (8 6 2 8 0 4) 後、酢酸エチルを留去し、 残留する抽状物はシリカゲル 2 0 0 8 を用いてカラムタロマトグラフィーを行う。 エーテルー 1 1 4 で溶出し、 2 - タロロー 3 - {4- (2-(2-(2-2)) エチルオキシ) フェユル} プロピオン酸メチルエステル10、 7 g (4 4 6 8 %) を得る。

IR(液膜) \(\text{Cm}^{-1} \) 2945, 2850, 1745

1605, 1505, 1250, 1170, 1050

HMR & ppm CDC1; 0, 93(6H,t)

1, 3~1, 8(8H,m), 2, 52(4H,t), 2, 85

(8H,t), 3, 0~3, 5(2H,m), 5, 7(5H,8),

4, 0(2H,t), 4, 4(1H,t), 6, 78~7, 30(4H,q)

間激沸し、冷後水 50 回を加え生じた結晶をベン, ゼンーリグロインから再結晶すると 8 50 吨の 8 ・4 - ジオキソー 5 - (4 - (2 - メチルー 2 -フエニルプロピルオキシ)ペンジル]チアソリジンが得られる。

突施例 2

8-クロロー3-(4-(2-メチル-8-フ エニルプロピルオキシ)フエニル)プロピオン酸 エチル278。チオ尿薬118。スルホラン60 副を混和、110℃に6時間加熱後、2-3碳酸 10回(又は63-塩酸2回)を加えて16時間 煮沸する。冷後水13を加え補状物を分離し、し ばらく放置すると結晶化する。との結晶をベンゼ ン-3ダロインから再結晶し19、98の2、4 ージオキソー5-(4-(2-メチル-2-フエ ニルプロピルオキシ)ベンジル)チアゾリジンを 得る。

突发倒之

6) 2-クロロー3-(4-(2-メチルーまーフエニルプロピルオキャ)フエニルプロピルオキャ)

実施例 /.

a) 2-9ロロー3-[4-(2-メナルー3-フェニルプロピルオキシ)フェニル]プロピオン
酸エナル3。6g。ナオ尿素0、75g。スルホ
フン3型を混和、120℃K4時間加熱、冷後水
15型を加え油状物を分離する。この油状物にエーテルを加え不溶の結晶(1)と溶液(1)を浮別する。
戸液(1)を薄媒留去後ショカゲル(100g)のカ
フムK付し、9ロロボルムで流出するフラタションを集め1、7gのg。4-ジオキソー5-(4-(2-メナルー2-フェニルプロピルオキシ)ペンジル)ナアゾリジンを得た。

融点 107~108℃(ペンゼン-リグロイン)

一方結晶(のをエタノール/アセトン(5:1)
から再結晶すると分解点 210-21202イミノ-5-[4-(2-メチル-2-フエニル
プロピルオキシ)ペンジル)-4-オキソチアゾリジン18が得られる。この結晶 300 転をスルホラン2 間、6 第一塩酸 2 間と共に110℃5時

酸3335%,チオ尿素150%をスルホラン2制 と共に120℃で1.5時間加熱、53~塩酸2 叫を加えて更に5時間加熱後水10副を加える。 生じた結晶を搾取、2,4~ジオキソー5~(4 ~(2~メチル~2~フエニルプロピルオキシ) ペンジル)チアゾリジン310%を得る。

D) 2-クロロー3-(4-(2-メチル-2-フェニルプロピルオキシ)フェニル)プロピオン 酸ナトリウム355 Wを用いる) と全く同様に反応させると目的の2,4-ジオキソー5-(4-(2-メチル-2-フェニルプロピルオキシ)ペンジル]チアゾリジン310 Wを得る。

o) 3-クロロー3-(4-(2-メチル-2-フエニルプロピルオキシ)フエニル)プロピオン 酸アミド332電を用いて a)と全く同様に反応させ2,4-ジオキソー5-(4-(2-メチル -2-フエニルプロピルオキシ)ペンジル)チア ゾリジン340電を得る。

d) 2-クロロー3-(4-(2-メチル-3-フエニルプロピルオキシ)フエエル)プロピオン 限アンモニウム1、8g。ナオ尿素0、8gをエタノール10町にとかし、5時間加熱技水50畦 を加えるとネーイミノー5ー(4ー(ネーメナル - ネーフエニルプロピルオヤシ)ペンジル)ー4 - オキソチアゾリジン1、6gが得られる。

実 施 例 《

2-プロム-3-[4-(4-クロロペンジルオキシ)フエニル]プロピオン酸200%。チオ

尿素100%をジメテルスルホオキシド2側にと
かし110℃に3時間加熱、後水0。5 組を加え

更に5時間加熱する。水10側を加え生じた結晶
を消取、ペンゼン/n-ヘキサン(1:1)から
再結晶し、触点135-136℃の針状品2。4
-ジオキソー5-[4-(4-クロロペンジルオキシ)ペンジル]チアゾリジン170%を得た。

上記宍施例/~4に挙じてつぎの化合物を合成した。

化合物		再結准條		準用した 実 施 例
1	O1_CH4-	ペンゼン- n-ヘキテン	85- 86	1,4
. 2	C1- () -CH ₄ -	ペンゼンーシ クロヘキテン	135-136	1,4
5	CH ₂ -O-CH ₂ - CH ₃	ペンゼン- リグロイン	156-158	, 1,5
4	CH _s C _B H _s -O-CH _s -	イソプロピル エーテル	128-129	1
. 5	CH _s n-C _s H _s -O-CH _s - CH _s	エーテルーローへキサン	105-104	1,2
đ	CH _s n-C ₄ H _s -O-CH _a CH _s	シクロヘキサン	102-103	1
7	CH; D-C:H; 1-O-CH:-	シタロへキサン	101-108	8
8	CH ₃ n-C ₄ H ₁ a-C-CH ₄ - CH ₃	シクロヘキサン	107-108	8
	n-CyH ₁ s-O-CH ₂ CH ₃	シクロヘキサン	101-108	

遇 酱

化合物	A .	再始溶媒	融 点. (で)	学用した 実 施 偶
10	CH _a . CH _a -O-CH _a CH _a CH _a	エーテルーローヘキサン	101-102	. 1,2
11	CaHs n-CaHy-O-CHs- l CaHs	n-ヘキサン	69- 70	*
12	CH _a -CH _a -	ペンゼン- リグロイン	95- 94	1,3
13	O-cH, CH, CH,-	耐酸エチルー シクロヘキサン	79- 80.	. 1
14	CH.CH.CH.CH.	計被エチルー シクロヘキサン	82- 83	. 1
15	GE1	前酸エチルー ローヘキサン	130-131	2
16	CaHa-C-CHaCHa-	エーテルー ローヘキテン	87- 88	2
17	C1-()- CH ₂ CH ₂ -	酢酸エチル	148-149	2
18	CEL O-CH CEL	節数エチルー ローヘキテン	104-108	8

酱酱

化合物		再結溶媒		準用した 実 施 例
19	CH*CH*-	エーテルー カーヘキサン	72- 73	. 2
20	CaHa-CHaCHa-	耐酸エナルー ローヘキサン	108-105	2
21		エーテルー・ローヘキチン	110-111	2
22	CaHeO CHeCHe-		油状物 IR(cm ⁻¹)3200 1750, 1700, 1240 按膜	2
23	CEL - CEL CEL -	耐酸エチルー ローヘキサン	92- 95	1 2
24	CH-0 CH-CH-	開設エチルー ローヘキサン	1085-1095	2
25	GH* CH* CH*-	品被エナルー エーケル	152-153	2
26	O-cercar- cer	エーテルー ローヘキサン	84 85	1
27	○-cs-cs	エーテルー ローヘキテン	66- 67	1,3

特開 昭55-- 22636 (6)

化自物	*	,再給潛媒	点 組 (プ)	学用した 実 施 何
28	CH _a CH _a CH _a	エーテルー ローヘキサン	107-108	1
29	CH3-CO-CH4-	57100 09 2	106-107	8
30	CaHe-CHE-CHE-	エーテルー	104-105	2
51	CH, O-CH,- CH,	エーテルー ローヘキサン	107-108	2
32	OCH _s CH _s	エーテルーローヘキサン	68- 69	2
33	OCH, CH,	エーテル- n-ヘキテン	116-117	2
34	CH ₂ C-CH ₂ - CH ₃ - CH ₃	エーテルー・カーヘキサン	87- 88	8
36 ·	ED-C-CH ₂ - CH ₃	エーテル・	157-158	8
36	CH. O CH.	エーテルー・ローへキサン	106-107	2

	<u> </u>		22000.00	
化合物	· A	再結形媒	(3)	学用した 安 編 例
37	Ç -œ-	メタノール	185-184	1.
38	Ç. cg.cg.−	7000AA- 381-N	175-176	1,2
500	CH.CH.CH.	クロロホルム- · メタノール	176-177	
40	CH.CH.	DMF-水	209-210	1,2
41 '	(1) (SE*COS*-	391-N	167-168	2
42	CET E CETCET-	即数エチルー nーヘキサン	103-104	2 ,
- 43	Pcarcar-	エーテルーコーヘキサン	73- 74	2
4	Q	エーテルー カーヘキサン	52- C4	a .
45	CH.COX	257-p	195-1945	1

化合物	A	再結形採	(コ)	学用した 実 施 例
46	CHª CHª C	2000-272	82- 85	i .
47	CEI.~	n-712-A	121-122	1,2
48	CH _s	ペンゼン- リグロイン	137-138	1,2
وبه	CH:-	ンクロヘキサン	124-125	1
50	CH, CH,	リグロイン	8889	1
51	CH, CH, CH,	カーヘキサン	68- 69	1
52	CH	ベンゼン- リグロイン	136-137	1

実施例る 2-タロロ-5~(も~(&~モルホリノエチ ルオキシ)フエニル)プロピオン酸メチルエステ 20 j Ši

ル100g。チオウレアも、ちもgをスルホラン 100町中で、120℃に4時間加熱する。冷却 後、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加えて酢酸 エチルで抽出する。水洗乾燥(Ba.80.) 後酢酸 エチルを留去すると2-イミノー5-(4-(2 -モルホリノエチルオキシ)ペンジル) - 3 - オ キソチアゾリジンの結晶も、1g(40、8%) が得られる。酢酸エチルーメタノールから再結晶 する。 無色針状晶。 東東18.9-190℃ 上記2-イミノー8-(4-(2-モルホリノ エチルオキシ)ペンジル〕-3-オキソチアゾリ ジン4. 1gを2B-BC1 5 0 叫にとかし還流 下に16時間加熱する。冷却後飽和炭酸水素ナト リウム水溶液で中和し酢酸エチルで抽出する。水 洗乾燥(Ha:80。) 技能酸エチルを留去すると、 15 . 2,4~ジオキソー5~〔4~(2-モルホリノ エテルオキシ)ペンジル〕チアゾリジンの結晶3 . 8g(92、7%)が得られる。 ジメナルホル ムアミドー水から存結品する。無色プリズム品。 m.p.188-189°C

吳施傍2.

2-000-3-(4-[2-(8,8-94 ソプロピルアミノ)エチルオキシ〕フエニル】プ ロピオン酸メチルエステル9。08。チオウレア 2. 6日をカープタノール100日中で100℃ K15時間加熱する。冷却技能圧下にカープタノ ールを留去し、残留物に 2N・HC1 100 叫を加 えて100℃に6時間加熱する。冷却後飽和炭酸 水素ナトリウムで中和し、酢酸エチルで抽出する。 水洗乾燥(Na:80.)後、酢酸エチルを留去する と、5- (4-(2-(1,8-ジイソプロピル アミノ)エチルオキシ]ペンジル } ー 2 . 4 ージ オキソチアゾリジンの結晶6.0g(68、2分)が得られる。エタノールから再結晶する。無色 プリズム品。 虫 2.134-135℃ 突施倪 &

上記実施例るまたは2に挙じてつぎの化合物を 合成した。

特闘 昭55-- 22636 の

B-CHaCHa-0-- C#0

化合物	В	再始溶媒	(で) 点価	準用した 実 施 例
1	CE'>H-	エタノール	208-209	6,7
2	CaHa >H-	エタノール	146-147	6,7
3	n-CaH, n-CaH,>H-	エタノール	124-125	7
4	1-C:H;	エタノール	134-135	7
. 5	n-C4He>F-	<i>≖81−№</i>	98- 99	6.7
6	O	24)-N	232-234	7
7	- HC1	191-W	844-845	7

第1頁の続き

MInt. Cl.3

庁内整理番号 識別記号

(C 07 D 413/12 277/00

333/00)

(C 07 D 413/12

277/00 307/00)

7043-4C

6670-4C

者 藤田剛 @発 明

宝塚市長尾台1丁目13番地15号

昭和 53 年 10 月

特許庁長官

1. 事件の表示

昭和 53 年特許願第

2. 発明の名称

チアゾリジン誘導体

3. 補正をする者

出級第二種 大阪市東区道修町2丁目27 称(293)武田薬品工業株式会社

4. ft 理 人

大阪市徒川区十三本町2丁目17番85号

武田 黎品工業株式会社 大 阪 工 場 内 (

#理士(5844) 松 居 祥 二

東京連絡先 (特許法規課) 紅 話 278-2219



53.10.16

・ 補正の対象明細管の発明の詳細な説明の個

- る 補正の内
 - (1) 明細書第8頁第1~4行に記載の一般式(引))をつぎのように訂正する。

L1 i - C - R2 - O - CH2 - CH - C = O I NH NH

- (2) 同番第8頁第17行の「あげられる」の後に 「。」を挿入する。
- (3) 同番第10頁第18行の「49g」を「4. 9g」に訂正する。
- (4) 同答第13頁第10行の「2-B」を「2m -」に訂正する。
- (6) 同番第18頁に記載の化合物系20にかける 「C: H: -〇-CH: CH: -」を「C: H: O-〇-CH: CH: -」に訂正する。
- (6) 同答第22頁第1行の「100g」を「10.

手続補正書 自発

特許 庁 長官 殿

- 1. 事件の表示 昭和 5 3 年特許願第 9 5 6 7 3 号
- 2. 発明の名称 チアゾリジン誘導体
- 3. 補正をする者

 平件との関係 特許出願人

 住 所 大阪市東区選修町2丁目27番地
 名 称(293)武田 薬品工業株式会社

 代表者 小 西 新 兵 衛
- 4. 代 理 人 住 所 大阪市淀川区十三本町2丁目17番85号 成田葉品工業株式会社大阪工場内 氏 名 弁理士(5844) 松 居 祥 二

取京連絡先 (特許法規律) 記 話 278-2219

ま 補正により増加する発明の数

0g」に打正する。

(7) 同番第22頁第1行かよび第28頁第4行の

(8) 同番第22頁第6行および第11行の「ペン

ジルー3-」を「ペンジル・」-4-」に訂正す

「ナオウレア」を「ナオ尿素」に訂正する。

- る 補 正 の 対 象 明細管の発明の詳細な説明の鎖
- 補正の内容
 明細書第21頁の表の下につぎの配数を追加す

53	○ −σε₂ −	エーテル- n-ヘキサン	88- 89	2
54	CER.	エーテルー ローヘキサン	110-111	2

以上